PATENT COOPERATION TREATY

PCT

10/569482

INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

(Chapter I of the Patent Cooperation Treaty)

(PCT Rule 44bis)

Applicant's or agent's file reference O07F1443	FOR FURTHER ACTION	See item 4 below
International application No. PCT/JP2004/012563	International filing date (day/month/year) 31 August 2004 (31.08.2004)	Priority date (day/month/year) 01 September 2003 (01.09.2003)
International Patent Classification (8th See relevant information in Form P	edition unless older edition indicated) CT/ISA/237	
Applicant ONO PHARMACEUTICAL CO., LT	TD.	

 This international preliminary report on patentability (Chapter I) is issued by the International Bureau on behalf of the International Searching Authority under Rule 44 bis.1(a). This REPORT consists of a total of 6 sheets, including this cover sheet. In the attached sheets, any reference to the written opinion of the International Searching Authority should be read as a reto the international preliminary report on patentability (Chapter I) instead. This report contains indications relating to the following items: Box No. I Basis of the report 	ference				
In the attached sheets, any reference to the written opinion of the International Searching Authority should be read as a reto the international preliminary report on patentability (Chapter I) instead. 3. This report contains indications relating to the following items:	ference				
3. This report contains indications relating to the following items:	ference				
, T					
Box No. I Basis of the report					
F					
Box No. II Priority					
Box No. III Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability					
Box No. IV Lack of unity of invention	Lack of unity of invention				
Box No. V Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or indu applicability; citations and explanations supporting such statement	Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement				
Box No. VI Certain documents cited					
Box No. VII Certain defects in the international application					
Box No. VIII Certain observations on the international application					
4. The International Bureau will communicate this report to designated Offices in accordance with Rules 44bis.3(c) and 93bis.1 but not, except where the applicant makes an express request under Article 23(2), before the expiration of 30 months from the priority date (Rule 44bis .2).					
Date of issuance of this report 02 March 2006 (02.03.2006)					
The International Bureau of WIPO 34, chemin des Colombettes 1211 Geneva 20, Switzerland Authorized officer Masashi Honda					
Facsimile No. +41 22 740 14 35 Telephone No. +41 22 338 70 10					

Form PCT/IB/373 (January 2004)

1.44

3 4 5·1

電話番号 03-3581-1101 内線

発信人 日本国特許庁 (国際調査機関)

·			(_	
出願人代理人				REC'D 1	1 NOV 2004
岩谷,龍			,	WIPO	
あて名	様	•			P(
〒 530-0003			PC7 国際調査機関		
			(法施行規則 [PCT規則		•
大阪府大阪市北区堂島2丁目1番27号 桜橋千代田ピル5階			TPC 1 AUR	1143072. 11	·
		発送日 (日.月.年)	09.11	.2004	
		今後の手続きにつ			
出願人又は代理人 の書類記号 007F1443		「年後の子配さにつ	A.Clar La	12 2 PM 7	
国際出願番号 国際出願日	-		優先日		
	1. 0	8. 2004	(日.月.年)	01.0	9.2003
国際特許分類 (IPC) Int. Cl' C07D265,				, 417/	04, :.
A61K31/538, 45/00, A61P11/0	0, 1	1/06, 43/0	0.0.		·
出願人(氏名又は名称)	: n *	¹⁴ 14 → △ 51.			
小野菜		業株式会社 ————————			
1. この見解告は次の内容を含む。		•			
× 第I欄 見解の基礎			•		
□ 第Ⅱ欄 優先権					
※ 第Ⅲ欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解の不作成第Ⅳ欄 発明の単一性の欠如					
X 第V欄 PCT規則43の2.1(a)(i)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、					
それを裏付けるための文献及び 第VI欄 ある種の引用文献	EC PJ				
第VII欄 国際出願の不備					•
※ 第価欄 国際出願に対する意見					
2. 今後の手続き					
国際予備審査の額求がされた場合は、出願人がこの国	国際調	査機関とは異なる国 国際調本機関の目標	国際予備審査	機関を選択し	し、かつ、そのE N日解本レみかき
際予備審査機関がPCT規則66.1の2(b)の規定に基づない冒を国際事務局に通知していた場合を除いて、こ	この見	国際調査機関の兄が 解書は国際予備審査	#骨を画原 J7 E機関の最初	の見解書と	クルか し みなされる。
この見解舎が上記のように国際予備審査機関の見解書					
63月又は優先日から22月のうちいずれか遅く満了	了する	期限が経過するまで	でに、出願人	は国際予備	許査機関に、適
な場合は補正沓とともに、答弁書を提出することができる。					
さらなる選択肢は、様式PCT/ISA/220を参照すること。					
3. さらなる詳細は、様式PCT/ISA/220の備考を参照すること。					
見解審を作成した日 20.10.2	200	4			
	—т	特許庁審査官(権限	見のある職員)	4 C 3 1 2
名称及びあて先 日本国際許庁 (ISA/IP)	.		裕美子	•	

東京都千代田区設が関三丁目4番3号

日本国特許庁 (ISA/JP) 郵便番号100-8915

	に示す場合を除く		<u> </u>		
・ この見解告は、 それは国際調査の	に示す場合を除く				
この見解書は、それは国際調査の	•	ほか、国際出願の官語を	基礎として作成された。	•	•
それは国際調査の		~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~	レンナ作成した。	•	
	のために提出された	_ 語による翻訳又を基礎 EPCT規則12.3及び23.	(b)にいう翻訳文の官	語でめる。	
				, スイルスコステイリー 眼 で	
. この国際出願で開示	されかつ請求の範	5囲に係る発明に不可欠な	ヌクレオテド又はアミ	ノ酸肥列に関して、	
以下に基づき見解書	を作成した。			•	18.567
a. タイプ	□ 配列表			er war en en en	
	配列表に関	連するテーブル	•	•	2.7.
	_	•		•	٠,
b. フォーマット	曹面		•		٠.
•	□ コンピュー	夕読み取り可能な形式	•		•
	□ -/	, , , , , , , , , , , , , , , , , , , 	• • •	•	
c. 提出時期	出願時の国	際出願に含まれる		•	•
с. 16гінджі		M願と共にコンピュータ読	ム	り提出された	
,	□ 出願後に、	調査のために、この国際	調査機関に提出された		
		•			
. 145 75 2 .					
4. 補足思見:				•	
4. 補足思見:				•	
1. 補足怠見:				·	
1. 補足意見:		•			
1. 補足怠見:					
1. 補足意見:					
1. 補足 思見 :					
4. 補足怠見:					
1. 補足 意 見:					
1. 補足意見:					
1. 補足意見:					
4. 補足意見:					
4. 補足怠克					
1. 補足意見:					
4. 補足意見:					
4. 補足意見:					

第Ⅲ	閥 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解の不作成
	次に関して、当該請求の範囲に記載されている発明の新規性、進歩性又は産業上の利用可能性につき、次の理由により 審査しない。
] 国際出願全体
×	請求の範囲
理由	に この国際出願又は請求の範囲 <u>16,17</u> は、国際予備審査をすることを要しない 次の事項を内容としている(具体的に記載すること)。
	請求の範囲16、17は治療による人体の処置方法に関するものであって、PC T17条(2)(a)(i)及びPCT規則39.1(iv)の規定により、この国際調査機関が予 備審査することを要しない対象に係るものである。
\Box	明細杏、請求の範囲若しくは図面(次に示す部分)又は請求の範囲の
	記載が、不明確であるため、見解を示すことができない (具体的に記載すること)。
	全部の請求の範囲又は請求の範囲
	室前の間水の範囲又は間水の範囲 裏付けを欠くため、見解を示すことができない。
X	請求の範囲 16,17 について、国際調査報告が作成されていない。
	ヌクレオチド又はアミノ酸の配列表が、実施細則の附属書C (塩基配列又はアミノ酸配列を含む明細書等の作成のためのガイドライン) に定める基準を、次の点で満たしていない。
	書面による配列表が
 	コンピュータ読み取り可能な形式による配列表が 提出されていない。 所定の基準を満たしていない。
	コンピュータ読み取り可能な形式によるヌクレオチド又はアミノ酸の配列表に関連するテーブルが、実施細則の附属書 Cの2に定める技術的な要件を、次の点で満たしていない。
	□ 提出されていない。 □ 所定の技術的な要件を満たしていない。
	詳細については補充欄を参照すること。

第V欄 新規性、進歩性又は産業」 それを裏付る文献及び説明	上の利用可能性についての 月	PCT規則43の2.1(a)(i)に定める見解、	.:
1. 見解			
新規性(N)	請求の範囲 請求の範囲	3-15, 18 1, 2	
進歩性(IS)	請求の範囲 請求の範囲	3-15, 18	
産業上の利用可能性 (IA)	請求の範囲	1-15, 18	有 無

2. 文献及び説明

文献 1: TOUZEAU, F. et al., Journal of Medicinal Chemistry, 2003, Vol. 46, No. 10, pp. 1962-1979

文献 2: MAYER, S. et al., Heterocycles, 2001, Vol. 55, No. 10, pp. 1873-1888

文献3: JP 11-92476 A (アディール エ コンパニー) 1999. 04. 06

文献 4: EVANS, J. M. et al, Br. J. clin. Pharmac., 1989, Vol. 28, pp. 125-135 文献 5: DENZILINGER, C. et al, Br. J. Pharmacol., 1991, Vol. 102, pp. 865-870

文献 6:0'BYRNE, P. M. et al, Annals of the New York Academy of Science,

1994, Vol. 744, pp. 251-261

文献 7: 村木正人 他,アレルギーの臨床,2002, Vol. 22, No. 10, pp. 759-764

*請求の範囲1、2:

請求の範囲1、2に係る発明は、国際調査報告で引用された文献1、2により新規性及び進歩性を有さない。

文献1のscheme 7,8に記載の化合物、及び、文献2のfigure 2に記載の化合物は、本願請求の範囲1、2に記載の化合物に包含されるものであるから、本願発明と文献1、2に記載の発明との間に、発明特定事項上の差異はない。

*請求の範囲3-15、18:

請求の範囲3-15、18に係る発明は、国際調査報告で引用されたいずれの文献にも記載されておらず、新規性及び進歩性を有する。

特に、本願明細書において開示された化合物がcysLT2介在性疾患の治療に有効であることについては、記載も示唆もされていない。

第四欄 国際出願に対する意見

請求の範囲、明細書及び図面の明瞭性又は請求の範囲の明細書による十分な裏付についての意見を次に示す。

請求の範囲1~9、11~15、18に係る発明は非常に多数の化合物を包含している。しかしながら、PCT6条の意味において明細書に裏付けられ、PCT5条の意味において開示されているのは、上記化合物のごくわずかな部分にすぎない。

また、請求の範囲 $1 \sim 18$ に記載された「プロドラッグ」なる文言は、明細書の記載を検討しても、具体的にいかなる化合物を包含し、また、包含しないか明確であるとはいえないから、本願発明の範囲を不明確にするものである。

特許協力多統

発信人 日本国特許庁 (国際調査機関)

出願人代理人	REC'D 1 1 NOV 2004			
岩谷・龍	WIPO PCT			
あて名	PCT			
〒 530−0003	国際調査機関の見解告 (法施行規則第40条の2)			
大阪府大阪市北区堂島2丁目1番27号 桜橋千代田ビル5階	[PCT規則43の2.1]			
	^{発送日} (日. 月. 年) 09.11.2004			
出願人又は代理人 の書類記号 007F1443	今後の手続きについては、下記2を参照すること。			
国際出願番号 PCT/JP2004/012563 国際出願日 (日.月.年) 31.	優先日 (日.月.年) 01.09.2003			
国際特許分類 (IPC) Int. Cl' C07D265/3				
A61K31/538, 45/00, A61P11/00,	11/06, 43/00			
出願人(氏名又は名称) 小野薬品コ	業株式会社			
1. この見解書は次の内容を含む。 ※ 第 I 欄 見解の基礎				
第Ⅲ欄 優先権 ※ 第Ⅲ欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可	能性についての見解の不作成			
第IV欄 発明の単一性の欠如				
▼ 第V欄 PCT規則43の2.1(a)(i)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、 それを裏付けるための文献及び説明				
第VI欄 ある種の引用文献				
第VII 網 国際出願の不備				
x 第2個 国際出願に対する意見 -				
2. 今後の手続き 国際予備審査の請求がされた場合は、出願人がこの国際調査機関とは異なる国際予備審査機関を選択し、かつ、その国 際予備審査機関がPCT規則66.1の2(b)の規定に基づいて国際調査機関の見解書を国際予備審査機関の見解書とみなさ ない冒を国際事務局に通知していた場合を除いて、この見解書は国際予備審査機関の最初の見解書とみなされる。				
この見解告が上記のように国際予備審査機関の見解告とみなされる場合、様式PCT/ISA/220を送付した日から3月又は優先日から22月のうちいずれか遅く満了する期限が経過するまでに、出願人は国際予備審査機関に、適当な場合は補正書とともに、答弁書を提出することができる。				
さらなる選択肢は、様式PCT/ISA/220を参照すること。				
3. さらなる詳細は、様式PCT/ISA/220の備考を参照すること。				
見解査を作成した日 20.10.2004				
名称及びあて先 日本国特許庁 (ISA/JP) 郵便番号100-8915	特許庁審査官(権限のある職員) 川口 裕美子			
東京都千代田区設が関三丁目4番3号	電話番号 03-3581-1101 内線 3451			

様式PCT/ISA/237 (表紙) (2004年1月)

		1 d 2 d 2 d 2 d 2 d 2 d 2 d 2 d 2 d 2 d
【欄 見解の基礎		
この見解告は、下	己に示す場合を除くほか、国際出願の冒語を基礎として作成された。	
_	毎にトス細む立た基礎として作成した。	
それは国際調査	のために提出された P C T 規則12.3及び23.1(b)にいう翻訳文の言語である。	
•	The second secon	朝 1 ナ ・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・
この国際出願で開	示されかつ請求の範囲に係る発明に不可欠なヌクレオチド又はアミノ酸配列に - 2.24-2-3-4	対して、
以下に基づき見解	野を作成した。 ・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・	ne di i
a . タイプ	配列表	Service Control
	配列表に関連するテーブル	ii.
o. フォーマット	一 春 面	
J. 74 · 7.	□ コンピュータ読み取り可能な形式	
	コンピューク ppe アルソ つ pp. のパンペ	•
io i cot un	出願時の国際出願に含まれる	
2. 提出時期	· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·	<i>.</i>
	この国際出願と共にコンピュータ読み取り可能な形式により提出され	
	出願後に、調査のために、この国際調査機関に提出された	
	表又は配列表に関連するテーブルを提出した場合に、出願後に提出した配列を	
. 補足意見:		
		• : • :
	•	
		. •
		•
•		
		i i
		5 ".
		-
		•

第Ⅲ欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解の不作成	· · ·
1. 次に関して、当該請求の範囲に記載されている発明の新規性、進歩性又は産業上の利用可能性につき、 審査しない。	次の理由により
国際出願全体	1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1
※ 請求の範囲 16,17	
理由:	ことを要しない
請求の範囲16、17は治療による人体の処置方法に関するものであ T17条(2)(a)(i)及びPCT規則39.1(iv)の規定により、この国際調理 備審査することを要しない対象に係るものである。	って、PC 査機関が予
明細書、請求の範囲若しくは図面(次に示す部分)又は請求の範囲	の
記載が、不明確であるため、見解を示すことができない(具体的に記載すること)。	
	٠.
	·
	• •
全部の請求の範囲又は請求の範囲 裏付けを欠くため、見解を示すことができない。	細書による十分な
X	れていない。
ヌクレオチド又はアミノ酸の配列表が、実施細則の附属書C (塩基配列又はアミノ酸配列を含む明細のガイドライン) に定める基準を、次の点で満たしていない。	書等の作成のため
ります。	
コンピュータ読み取り可能な形式による配列表が 提出されていない。 所定の基準を満たしていない。	•
コンピュータ読み取り可能な形式によるヌクレオチド又はアミノ酸の配列表に関連するテーブルが、 Cの2に定める技術的な要件を、次の点で満たしていない。	実施細則の附属部
□ 提出されていない。 □ 所定の技術的な要件を満たしていない。	. •
詳細については補充欄を参照すること。	

1. , 見解		·	_
新規性(N)	eti-b-o-weii		
NIME (IV)	請求の範囲 請求の範囲 	3-15, 18	有無
進歩性(IS)	請求の範囲 請求の範囲	3-15, 18 1, 2	有無
産業上の利用可能性 (I A)	請求の範囲 請求の範囲	1-15, 18	 有無

2. 文献及び説明

文献 1: TOUZEAU, F. et al., Journal of Medicinal Chemistry, 2003, Vol. 46, No. 10, pp. 1962-1979

文献 2: MAYER, S. et al., Heterocycles, 2001, Vol. 55, No. 10, pp. 1873-1888

文献3: JP 11-92476 A (アディール エ コンパニー) 1999. 04. 06

文献 4 : EVANS, J. M. et al, Br. J. clin. Pharmac., 1989, Vol. 28, pp. 125-135

文献 5: DENZILINGER, C. et al, Br. J. Pharmacol., 1991, Vol. 102, pp. 865-870

文献 6:0'BYRNE, P. M. et al, Annals of the New York Academy of Science,

1994, Vol. 744, pp. 251-261

文献7:村木正人 他,アレルギーの臨床,2002, Vol. 22, No. 10, pp. 759-764

*請求の範囲1、2:

請求の範囲1、2に係る発明は、国際調査報告で引用された文献1、2により新 規性及び進歩性を有さない。

文献1のscheme 7,8に記載の化合物、及び、文献2のfigure 2に記載の化合物は、本願請求の範囲1、2に記載の化合物に包含されるものであるから、本願発明と文献1、2に記載の発明との間に、発明特定事項上の差異はない。

*請求の範囲3-15、18:

請求の範囲3-15、18に係る発明は、国際調査報告で引用されたいずれの文献にも記載されておらず、新規性及び進歩性を有する。

特に、本願明細書において開示された化合物がcysLT2介在性疾患の治療に有効であることについては、記載も示唆もされていない。

第2個 国際出願に対する意見

請求の範囲、明細書及び図面の明瞭性又は請求の範囲の明細書による十分な裏付についての意見を次に示す。

請求の範囲1~9、11~15、18に係る発明は非常に多数の化合物を包含している。しかしながら、PCT6条の意味において明細書に裏付けられ、PCT5条の意味において開示されているのは、上記化合物のごくわずかな部分にすぎない。

また、請求の範囲1~18に記載された「プロドラッグ」なる文言は、明細書の記載を検討しても、具体的にいかなる化合物を包含し、また、包含しないか明確であるとはいえないから、本願発明の範囲を不明確にするものである。